

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 7 月 29 日 (29.07.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/063221 A1(51) 国際特許分類: C07K 14/47, A61K 38/00, A61P 1/18,
3/04, 3/06, 3/10, 7/02, 9/10, 13/00, 15/00, 15/06, 15/08,
25/28, 35/00, 35/04, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/016978

(22) 国際出願日: 2003 年 12 月 26 日 (26.12.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

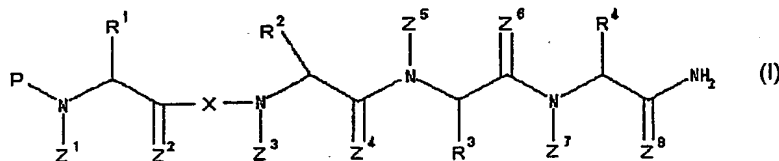
(30) 優先権データ:
特願 2002-377179
2002 年 12 月 26 日 (26.12.2002) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 武田薬品
工業株式会社 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES,
LTD.) [JP/JP]; 〒541-0045 大阪府 大阪市 中央区道修
町四丁目 1 番 1 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 北田 千恵
子 (KITADA, Chieko) [JP/JP]; 〒590-0073 大阪府
堺市 南向陽町 1 丁 2-8 Osaka (JP). 浅見 泰司
(ASAMI, Taiji) [JP/JP]; 〒305-0047 茨城県 つくば
市 千現 2 丁目 12-14 Ibaraki (JP). 西澤 直城
(NISHIZAWA, Naoki) [JP/JP]; 〒661-0981 兵庫県 尼
崎市 猪名寺 1 丁目 18-23 Hyogo (JP). 大瀧 徹
也 (OHTAKI, Tetsuya) [JP/JP]; 〒305-0031 茨城県 つ
くば市 吾妻 3 丁目 14-32 Ibaraki (JP). 樽井 直
樹 (TARUI, Naoki) [JP/JP]; 〒631-0061 奈良県 奈良
市 三碓 1 丁目 6-1 Nara (JP). 松本 寛和 (MAT-
SUMOTO, Hirokazu) [JP/JP]; 〒305-0821 茨城県 つくば市 春日 2 丁目 35-10 Ibaraki (JP). 野口 次郎
(NOGUCHI, Jiro) [JP/JP]; 〒305-0051 茨城県 つくば
市 二の宮 1 丁目 10-19-1-205 Ibaraki (JP). 松
井 久典 (MATSUI, Hisanori) [JP/JP]; 〒300-1237 茨城
県 牛久市 田宮 2 丁目 37-7-B-201 Ibaraki (JP).(74) 代理人: 小林 浩, 外 (KOBAYASHI, Hiroshi et al.); 〒
104-0028 東京都 中央区 八重洲二丁目 8 番 7 号 福岡
ビル 9 階 阿部・井窪・片山法律事務所 Tokyo (JP).(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR,
HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI,
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,
SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).添付公開書類:
— 国際調査報告書2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: METASTIN DERIVATIVE AND USE THEREOF

(54) 発明の名称: メタスチン誘導体およびその用途



alkyl; each of Z², Z⁴, Z⁶ and Z⁸ is H, O or S; R¹ is H, carbamoyl, etc.; R² is H, cyclic C₁-C₁₀ alkyl, etc.; R³ is C₁-C₈ alkyl having a basic group, etc.; R⁴ is C₆-C₁₂ aromatic hydrocarbon ring group, etc.; X is -NHCH(Q1)YQ2C(=Z9)- (wherein Q1 is C₆-C₁₂ aromatic hydrocarbon ring group, etc.; Q2 is CH₂, etc.; Y is CONH, etc.; and Z9 is H, etc.); and P is arbitrary amino acid residues discontinuously bonded or continuous from the C-terminal side of 1st-48th amino acid sequence segment of specified amino acid sequence, etc.

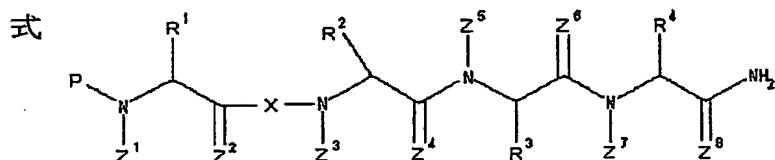
(57) Abstract: A metastasin derivative or salt thereof excelling in stability in blood and exhibiting cancerous metastasis inhibitory action or cancerous hyperplasia inhibitory action. The metastasin derivative is represented by the formula: (I) wherein each of Z¹, Z³, Z⁵ and Z⁷ is H or C₁-C₃

[続葉有]



(57) 要約:

本発明は、血中安定性に優れ、癌転移抑制作用又は癌増殖抑制作用を有する下記式で表されるメタスチン誘導体（I）又はその塩を提供する。



[式中、Z₁、Z₃、Z₅及びZ₇はH又はC₁₋₃アルキル基を、Z₂、Z₄、Z₆及びZ₈はH、O又はSを、R₁はH、カルバモイル基等を、R₂はH、環状のC₁₋₁₀アルキル基等を、R₃は塩基性基を有するC₁₋₈アルキル基等を、R₄はC₆₋₁₂芳香族炭化水素環基等を、Xは-NHCH(Q₁)YQ₂C(=Z₉)-（式中、Q₁はC₆₋₁₂芳香族炭化水素環基等、Q₂はCH₂基等、YはCONH等、Z₉はH等）を、Pは特定のアミノ酸配列の第1-48番目のアミノ酸配列のC末端側から任意の連続した又は不連続に結合したアミノ酸残基等を表す。]